

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 6 月 9 日 (09.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/051930 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 257/04, A61K 31/5377, 31/41, 31/4192, 31/496, 31/541, A61P 3/10, 7/08, 9/10, 13/12, 25/00, 25/16, 25/28, 27/02, 29/00, A61M 1/14, C07D 487/04

(74) 代理人: 河宮 治 外(KAWAMIYA, Osamu et al.); 〒5400001 大阪府大阪市中央区城見 1 丁目 3 番 7 号 I M P ビル 青山特許事務所 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/017267

(22) 国際出願日: 2004 年 11 月 19 日 (19.11.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2003-397740
2003 年 11 月 27 日 (27.11.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 学校法人東海大学 (TOKAI UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒1510063 東京都渋谷区富ヶ谷 2 丁目 2 番 4 号 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

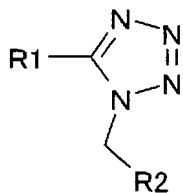
(71) 出願人 および
(72) 発明者: 宮田 敏男 (MIYATA, Toshio) [JP/JP]; 〒2591132 神奈川県伊勢原市桜台 2 丁目 1 6-2 5 エクセル伊勢原 1 0 2 号 Kanagawa (JP). 黒川 清 (KUROKAWA, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒1620061 東京都新宿区市谷柳町 4 9 市ヶ谷ヒルズ 4 0 1 Tokyo (JP).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

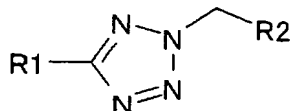
2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: MODIFIED-PROTEIN FORMATION INHIBITOR

(54) 発明の名称: 蛋白修飾物生成抑制剤



(I)



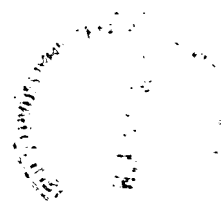
(II)

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a modified-protein formation inhibitor that exhibits intense excellent modified-protein formation inhibiting effects without causing any blood pressure drop. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] There is provided a modified-protein formation inhibitor comprising as an active ingredient a compound consisting of a tetrazole ring having, via methylene, various substituents, especially compound (I) or (II) of the following formula: (I) (II) (wherein R1 and R2 represent monovalent organic groups identical with or different from each other). This modified-protein formation inhibitor is useful in the prevention and treatment of diseases associated with AGEs and ALEs, for example, used as a renal tissue protector alone or in mixture in a peritoneal dialyzing solution or hemodialysate.

[続葉有]

ATTACHMENT F

WO 2005/051930 A1



(57) 要約:

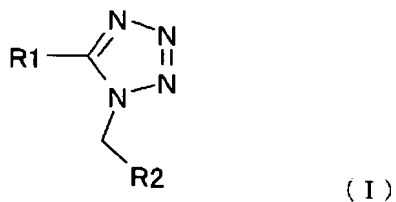
(課題)

強力かつ優れた蛋白修飾物生成抑制効果を有し、さらに血圧降下を伴わない蛋白修飾物生成抑制剤を提供すること。

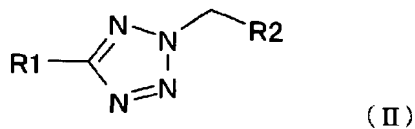
(解決手段)

テトラゾール環にメチレンを介して各種の置換基を有する化合物、特に次の式で示される化合物 (I) または (II) :

[化1]



[化2]



[式中R1およびR2は、同一または異なった1価の有機基を表わす。]

を有効成分と使用することにより、上記課題を解決することが出来た。この蛋白修飾物生成抑制剤は、AGEsやALEsに関連する疾患の予防や治療に有用であって、具体的には腎組織保護剤として単独でまたは腹膜または血液透析液に配合して使用される。